

(19) Országkód:

**HU**



**MAGYAR  
KÖZTÁRSASÁG  
ORSZÁGOS  
TALÁLMÁNYI  
HIVATAL**

## **SZABADALMI LEÍRÁS**

(11) Lajstromszám:

**210 817 A9**

(21) A kérelem ügyszám: P/P 00093

(22) A bejelentés napja: 1995. 03. 29.

(30) Elsőbbségi adatok:

335 888/911991. 11. 27. JP

215 613/921992. 07. 21. JP

*Priniciples*

Az alapul szolgáló szabadalom

száma: 651 505 országkódja: AU

Az eredeti oltalom kezdete: 1992. 11. 25.

(51) Int. Cl.<sup>6</sup>

**C 07 D 477/00**

**A 61 K 31/40**

(72) Feltalálók:

Nakagawa, Susumu, Ibaraki (JP)

Murase, Satoshi, Ibaraki (JP)

Fukatsu, Hiroshi, Ibaraki (JP)

Kato, Shinji, Ibaraki (JP)

Okamoto, Osamu, Ibaraki (JP)

Mitomo, Ryuji, Ibaraki (JP)

Yamada, Koji, Ibaraki (JP)

Yamamoto, Katsumi, Ibaraki (JP)

(73) Szabadalmaz:

Banyu Pharmaceutical Co. Ltd., Tokió (JP)

(74) Képviselő:

ADVOPATENT Szabadalmi Iroda, Budapest

(54)

**Aminoalkil-pirrolidinil-tiokarbapeném-származékok**

Az átmeneti oltalom az 1–12. és 15–18. igénypontokra vonatkozik.

A leírás terjedelme: 120 oldal (ezen belül 45 lap ábra)

**HU 210 817 A9**

használnuk. Ily módon 1,070 g (85,2%) cím szerinti vegyületet kapunk.

NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 2,23–2,74 (3H, m); 3,06 (3H, s); 3,80 (3H, s); 4,12 (1H, m); 4,64 (1H, m); 5,32 (1H, m); 8,27 (1H, s).

#### 60. referenciapélda

(2S,4R)-4-(*tert*-Butil-dimetil-sziloxi)-N-formil-prolin-metil-észter [(275) képletű vegyület]

3,46 g (20,0 mmol) (2S,4R)-1-formil-4-hidroxi-prolin-metil-észter 10 ml N,N-dimetil-formamiddal és 20 ml metilén-dikloriddal készült oldatához nitrogénatmoszférában, jeges hűtés és keverés közben 3,20 g (21,2 mmol) (*tert*-butil)-klór-dimetil-szilánt és 1,47 g (21,6 mmol) imidazolt adunk. Az elegyet szobahőmérsékleten 4 órán át keverjük, majd vízzel mossuk, vízmentes nátrium-szulfáton szárítjuk, és vákuumban bepároljuk. A maradékot szilikagél (Wakogel™ C-300) oszlopon kromatografáljuk, eluálószerként heptán és etil-acetát 1:1 térfogatarányú elegyét használjuk. Ily módon 5,54 g (96,3%) cím szerinti vegyületet kapunk. NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 0,06 (6H, s); 0,85 (9H, s); 2,03–2,26 (2H, m); 3,43–3,76 (5H, m); 4,42–4,59 (2H, m); 8,23 (1H, s).

### SZABADALMI IGÉNYPONTOK

1. (I) általános képletű vegyületek, a képletben

R<sup>1</sup> hidrogénatom vagy metilcsoport,

R<sup>2</sup> hidrogénatom vagy negatív töltés,

R<sup>3</sup> hidrogénatom, halogénatom, hidroxilcsoport, kevés szénatomos alkoxicssoport, kevés szénatomos alkanol-oxi-csoport, aminocsoport, N-(keves szénatomos)alkil-amino-csoport, N,N-di(keves szénatomos)alkil-amino-csoport, kevés szénatomos alkanol-amino-csoport, aroil-amino-csoport, kevés szénatomos alkil-szulfonil-amino-csoport, szulfamoiil-amino-csoport, cianocsoport, nitrocsoport; -COOR<sup>4</sup> általános képletű csoport, amelyben R<sup>4</sup> hidrogénatom vagy kevés szénatomos alkilcsoport, vagy

-CONR<sup>5</sup>R<sup>6</sup> általános képletű csoport, amelyben R<sup>5</sup> és R<sup>6</sup> azonos vagy különböző, és hidrogénatom vagy kevés szénatomos alkilcsoport, vagy R<sup>5</sup> és R<sup>6</sup> a közbezárt nitrogénatommal együtt heterociklus csoportot, így aziridinil-, azetidínil-, piperidinil-, piperazinil-, 4-(keves szénatomos)alkil-piperazinil- vagy morfolinilcsoportot képez;

A egyenes vagy elágazó szénláncú kevés szénatomos alkilcsoport;

X -NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup> általános képletű csoport, amelyben R<sup>7</sup> és R<sup>8</sup> azonos vagy különböző, és hidrogénatomot vagy kevés szénatomos alkilcsoportot jelent, vagy -N<sup>+</sup>R<sup>9</sup>R<sup>10</sup>R<sup>11</sup> általános képletű csoport, amelyben R<sup>9</sup>, R<sup>10</sup>, R<sup>11</sup> azonos vagy különböző, és kevés szénatomos alkilcsoportot jelent,

azzal a megkötéssel, hogy amikor A egyenesláncú ke-

vés szénatomos alkilcsoport, R<sup>3</sup> jelentése hidrogénatomtól eltérő, vagy gyógyászatilag elfogadható sóik vagy észterek.

2. Az 1. igénypont szerinti, (I-a) általános képletű vegyületek, a képletben

R<sup>1</sup> hidrogénatom vagy metilcsoport;

R<sup>2</sup> hidrogénatom vagy negatív töltés;

R<sup>3a</sup> hidrogénatom, halogénatom, hidroxilcsoport, kevés szénatomos alkoxicssoport, kevés szénatomos alkanol-oxi-csoport, aminocsoport, N-(keves szénatomos)alkil-amino-csoport, kevés szénatomos alkanol-amino-csoport, kevés szénatomos alkil-szulfonil-amino-csoport, cianocsoport vagy karbamoilcsoport;

A egyenes vagy elágazó szénláncú kevés szénatomos alkilcsoport;

X -NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup> általános képletű csoport, amelyben R<sup>7</sup> és R<sup>8</sup> azonos vagy különböző, és hidrogénatom vagy kevés szénatomos alkilcsoport, vagy

-N<sup>+</sup>R<sup>9</sup>R<sup>10</sup>R<sup>11</sup> általános képletű csoport, amelyben R<sup>9</sup>, R<sup>10</sup> és R<sup>11</sup> azonos vagy különböző, és kevés szénatomos alkilcsoportot jelent,

azzal a megkötéssel, hogy amikor A egyenesláncú kevés szénatomos alkilcsoport, R<sup>3a</sup> jelentése hidrogénatomtól eltérő, vagy gyógyászatilag elfogadható sóik vagy észterek.

3. Az 1. igénypont szerinti, (I-b) általános képletű vegyületek, a képletben

R<sup>1</sup> hidrogénatom vagy metilcsoport;

R<sup>2</sup> hidrogénatom vagy negatív töltés;

R<sup>3b</sup> hidrogénatom, hidroxilcsoport, aminocsoport, kevés szénatomos alkanol-amino-csoport, kevés szénatomos alkil-szulfonil-amino-csoport, cianocsoport vagy karbamoilcsoport;

A egyenes vagy elágazó szénláncú kevés szénatomos alkilcsoport;

X -NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup> általános képletű csoport, amelyben R<sup>7</sup> és R<sup>8</sup> azonos vagy különböző, és hidrogénatom vagy kevés szénatomos alkilcsoport vagy

-N<sup>+</sup>R<sup>9</sup>R<sup>10</sup>R<sup>11</sup> általános képletű csoport, amelyben R<sup>9</sup>, R<sup>10</sup> és R<sup>11</sup> azonos vagy különböző, és kevés szénatomos alkilcsoportot jelent,

azzal a megkötéssel, hogy ha A egyenesláncú kevés szénatomos alkilcsoport, R<sup>3b</sup> hidrogénatomtól eltérő, vagy gyógyászatilag elfogadható sóik vagy észterek.

4. Az 1. igénypont szerinti, (I-c) általános képletű vegyületek, a képletben

R<sup>1</sup> hidrogénatom vagy metilcsoport;

R<sup>2</sup> hidrogénatom vagy negatív töltés;

R<sup>3c</sup> halogénatom, kevés szénatomos alkoxicssoport, N-(keves szénatomos)alkil-amino-csoport vagy kevés szénatomos alkanol-oxi-csoport;

A egyenes vagy elágazó szénláncú kevés szénatomos alkilcsoport;

X -NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup> általános képletű csoport, amelyben R<sup>7</sup> és R<sup>8</sup> azonos vagy különböző, és hidrogénatom vagy kevés szénatomos alkilcsoport, vagy

-N<sup>+</sup>R<sup>9</sup>R<sup>10</sup>R<sup>11</sup> általános képletű csoport, amelyben R<sup>9</sup>, R<sup>10</sup> és R<sup>11</sup> azonos vagy különböző, és kevés szénatomos alkilcsoportot jelent,

60 azzal a megkötéssel, hogy ha A egyenesláncú kevés

szénatomos alkilénecsopót, R<sup>3c</sup> hidrogénatomtól eltérő; vagy gyógyászatiilag elfogadható sóik vagy észteriek.

5. Az 1. igénypont szerinti olyan vegyületek, amelyekben A elágazó szénláncú kevés szénatomos alkilénecsopót.

6. Az 1. igénypont szerinti olyan vegyületek, amelyekben R<sup>3</sup> hidroxilcsopót.

7. Az 1. igénypont szerinti olyan vegyületek, amelyekben A elágazó szénláncú kevés szénatomos alkilénecsopót és R<sup>3</sup> hidrogénatom, hidroxilcsopót vagy karbamoilcsopót.

8. Az 1. igénypont szerinti olyan vegyületek, amelyekben A egyenesláncú kevés szénatomos alkilénecsopót, és R<sup>3</sup> halogénatom, hidroxilcsopót, kevés szénatomos alkoxilcsopót, kevés szénatomos alkanoil-oxilcsopót, aminocsopót, kevés szénatomos alkanoil-amino-csoport, cianocsopót vagy karbamoilcsopót.

9. Az 1. igénypont szerinti olyan vegyületek, amelyek szterikus konfigurációja (5R,6S,8R) vagy (1R,5S,6S,8R).

10. Az olyan 1. igénypont szerinti vegyületek, amelyekben R<sup>1</sup> metilcsopót.

11. Az 1. igénypont szerinti vegyületek közül az alábbiak:

(5R,6S)-2-[(2S,4S)-2-[1-(amino-metil)-2-karbamoil-etil]-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,

(1R,5S,6S)-2-[(2S,4S)-2-[1-(amino-metil)-2-karbamoil-etil]-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-metil-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,

(5R,6S)-2-[(2R,4S)-2-(2-amino-2-karbamoil-etil)-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,

(1R,5S,6S)-2-[(2R,4S)-2-(2-amino-2-karbamoil-etil)-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-metil-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,

(5R,6S)-2-[(2S,4S)-2-(1-acetamido-2-amino-etil)-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,

(1R,5S,6S)-2-[(2S,4S)-2-(1-acetamido-2-amino-etil)-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-metil-karbapen-2-em-3-karbonsav,

(5R,6S)-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-2-[(2S,4S)-2-[1-(metánszulfonil-amido)-2-amino-etil]-pirrolidin-4-il-tio]-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,

(1R,5S,6S)-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-metil-2-[(2S,4S)-2-[1-(metánszulfonil-amido)-2-amino-etil]-pirrolidin-4-il-tio]-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,

(5R,6S)-2-[(2S,4S)-2-(1-amino-1-ciano-metil)-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,

(1R,5S,6S)-2-[(2S,4S)-2-(1-amino-1-ciano-metil)-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-metil-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,

(5R,6S)-2-[(2R,4S)-2-(3-amino-2-metil-propil)-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,

(1R,5S,6S)-2-[(2R,4S)-2-(3-amino-2-metil-propil)-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-metil-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,

(5R,6S)-2-[(2S,4S)-2-(3-amino-1-hidroxi-propil)-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,

(1R,5S,6S)-2-[(2S,4S)-2-(3-amino-1-hidroxi-propil)-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-metil-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,

(5R,6S)-2-[(2S,4S)-2-(1,3-diamino-propil)-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,

(1R,5S,6S)-2-[(2S,4S)-2-(1,3-diamino-propil)-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-metil-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,

(5R,6S)-2-[(2S,4S)-2-(2-amino-1-hidroxi-etil)-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,

(1R,5S,6S)-2-[(2S,4S)-2-(2-amino-1-hidroxi-etil)-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-metil-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,

(5R,6S)-2-[(2R,4S)-2-(3-amino-2,2-dimetil-propil)-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,

(1R,5S,6S)-2-[(2R,4S)-2-(3-amino-2,2-dimetil-propil)-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-metil-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,

(5R,6S)-2-[(2R,4S)-2-[2,2-dimetil-3-(metil-amino)-propil]-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,

(1R,5S,6S)-2-[(2R,4S)-2-[2,2-dimetil-3-(metil-amino)-propil]-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-metil-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,

(5R,6S)-2-[(2S,4S)-2-[1-(amino-metil)-3-hidroxi-propil]-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,

(1R,5S,6S)-2-[(2S,4S)-2-[1-(amino-metil)-3-hidroxi-propil]-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-metil-karbapen-2-em-3-karbonsav,

(5R,6S)-2-[(2S,4S)-2-[(1R)-1-metoxi-3-(N-metil-amino)-propil]-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,

(1R,5S,6S)-2-[(2S,4S)-2-[(1R)-1-metoxi-3-(N-metil-amino)-propil]-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-metil-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,

(5R,6S)-2-[(2S,4S)-2-[(1S)-1-hidroxi-3-(N-metil-amino)-propil]-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,

(1R,5S,6S)-2-[(2S,4S)-2-[(1S)-1-hidroxi-3-(N-metil-amino)-propil]-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-metil-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,

(5R,6S)-2-[(2S,4S)-2-[(1R)-1-hidroxi-3-(N-metil-amino)-propil]-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,

(1R,5S,6S)-2-[(2S,4S)-2-[(1R)-1-hidroxi-3-(N-metil-amino)-propil]-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-metil-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,

(5R,6S)-2-[(2S,4S)-2-[(1S)-1-hidroxi-2-(N-metil-amino)-etil]-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,

(1R,5S,6S)-2-[(2S,4S)-2-[(1S)-1-hidroxi-2-(N-metil-amino)-etil]-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-metil-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,

(5R,6S)-2-[(2S,4S)-2-[(1R)-1-hidroxi-2-(N-metil-amino)-etil]-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-metil-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,

(5R,6S)-2-[(2S,4S)-2-[(1R)-1-hidroxi-2-(N-metil-amino)-etil]-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,  
 (1R,5S,6S)-2-[(2S,4S)-2-[(1R)-1-hidroxi-2-(N-metil-amino)-etil]-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-metil-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,  
 (5R,6S)-2-[(1R)-1-hidroxi-etil]-2-[(2R,4S)-2-[(N-metil-amino)-propil]-pirrolidin-4-il-tio]-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,  
 (1R,5S,6S)-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-2-[(2R,4S)-2-[(N-metil-amino)-propil]-pirrolidin-4-il-tio]-1-metil-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,  
 (5R,6S)-2-[(2R,4S)-2-[(N-metil-amino)-propil]-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,  
 (1R,5S,6S)-2-(2R,4S)-2-[(3-hidroxi-2-(N-metil-amino)-propil]-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,  
 (1R,5S,6S)-2-(2R,4S)-2-[(3-hidroxi-2-(N-metil-amino)-propil]-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-metil-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,  
 (5R,6S)-2-[(2R,4S)-2-(2-amino-2-metil-propil)-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,  
 (1R,5S,6S)-2-[(2R,4S)-2-(2-amino-2-metil-propil)-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-metil-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,  
 (5R,6S)-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-2-[(2R,4S)-2-[(2-metil-2-(N-metil-amino)-propil]-pirrolidin-4-il-tio)-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,  
 (1R,5S,6S)-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-metil-2-[(2R,4S)-2-[(2-metil-2-(N-metil-amino)-propil]-pirrolidin-4-il-tio)-1-metil-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,  
 (5R,6S)-2-[(2R,4S)-2-(3-amino-3-metil-butil)-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,  
 (1R,5S,6S)-2-[(2R,4S)-2-(3-amino-3-metil-butil)-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-metil-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,  
 (5R,6S)-2-[(2S,4S)-2-[1-(amino-metil)-3-hidroxi-propil]-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,  
 (1R,5S,6S)-2-[(2S,4S)-2-[1-(amino-metil)-3-hidroxi-propil]-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-metil-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,  
 (5R,6S)-2-[(2S,4S)-2-[1-(2-amino-etil)-3-hidroxi-propil]-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,  
 (1R,5S,6S)-2-[(2S,4S)-2-[1-(2-amino-etil)-3-hidroxi-propil]-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-metil-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,  
 (5R,6S)-2-[(2R,4S)-2-(3-amino-2-hidroxi-propil)-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,  
 (1R,5S,6S)-2-[(2R,4S)-2-(3-amino-2-hidroxi-propil)-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-metil-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,  
 (5R,6S)-2-[(2R,4S)-2-(2-acetoxi-3-amino-propil)-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,  
 (1R,5S,6S)-2-[(2R,4S)-2-(2-acetoxi-3-amino-propil)-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-metil-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,

(5R,6S)-2-[(2R,4S)-2-(2-amino-propil)-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,  
 (1R,5S,6S)-2-[(2R,4S)-2-(2-amino-propil)-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-metil-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,  
 (5R,6S)-2-[(2R,4S)-2-[3-(N-metil-amino)-propil]-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,  
 (1R,5S,6S)-2-[(2R,4S)-2-[3-(N-metil-amino)-propil]-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-metil-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,  
 (5R,6S)-2-[(2R,4S)-2-[2-fluor-3-(N-metil-amino)-propil]-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,  
 (1R,5S,6S)-2-[(2R,4S)-2-[2-fluor-3-(N-metil-amino)-propil]-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-metil-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,  
 (5R,6S)-2-[(2R,4S)-2-[1-metil-3-(N-metil-amino)-propil]-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,  
 (1R,5S,6S)-2-[(2R,4S)-2-[1-metil-3-(N-metil-amino)-propil]-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-metil-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,  
 (5R,6S)-2-[(2R,4S)-2-[1-(amino-metil)-etil]-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,  
 (1R,5S,6S)-2-[(2R,4S)-2-[1-(amino-metil)-etil]-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-metil-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,  
 (5R,6S)-2-[(2S,4S)-2-[(1R)-3-(N,N-dimetil-amino)-1-hidroxi-propil]-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,  
 (1R,5S,6S)-2-[(2S,4S)-2-[(1R)-3-(N,N-dimetil-amino)-1-hidroxi-propil]-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-metil-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,  
 12. Az 1. igénypont szerinti (1R,5S,6S)-2-(2S,4S)-2-[(1R)-1-hidroxi-3-(N-metil-amino)-propil]-pirrolidin-4-il-tio-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-metil-1-karbapen-2-em-3-karbonsav.  
 13. (2S,4S)-4-Merkapto-2-[(1R)-1-hidroxi-3-(N-metil-amino)-propil]-pirrolidin.  
 14. Eljárás (I) általános képletű vegyületek, a képletben  
 45 R<sup>1</sup> hidrogénatom vagy metilcsoport,  
 R<sup>2</sup> hidrogénatom vagy negatív töltés,  
 R<sup>3</sup> hidrogénatom, halogénatom, hidroxilcsoport, kevés szénatomos alkoxycsoport, kevés szénatomos alkanol-oxi-csoport, aminocsoport, N-(kevésszénatomos)alkil-amino-csoport, N,N-di(kevésszénatomos)alkil-amino-csoport, kevés szénatomos alkanol-amino-csoport, aroil-amino-csoport, kevés szénatomos alkil-szulfonil-amino-csoport, szulfamoiil-amino-csoport, cianocsoport, nitrocsoport,  
 50 -COOR<sup>4</sup> általános képletű csoport, amelyben  
 55 R<sup>4</sup> hidrogénatom vagy kevés szénatomos alkilcsoport, vagy  
 -CONR<sup>5</sup>R<sup>6</sup> általános képletű csoport, amelyben  
 60 R<sup>5</sup> és R<sup>6</sup> azonos vagy különböző, és hidrogénatom vagy kevés szénatomos alkilcsoport, vagy

- $R^5$  és  $R^6$  a közbezárt nitrogénatommal együtt heterogén csoportot, így aziridinil-, azetidínil-, piroldinil-, piperidinil-, piperazinil-, 4-(kevésszé-  
natomos)alkil-piperazinil- vagy morfolinilcsoportot ké-  
pez.
- A egyenes vagy elágazó szénláncú kevés szénatomos  
alkilcsoport;
- X  $-NR^7R^8$  általános képletű csoport, amelyben  
 $R^7$  és  $R^8$  azonos vagy különböző, és hidrogén-  
atomot vagy kevés szénatomos alkilcsoportot je-  
lent, vagy  
 $-N^+R^9R^{10}R^{11}$  általános képletű csoport, amelyben  
 $R^9$ ,  $R^{10}$ ,  $R^{11}$  azonos vagy különböző, és kevés  
szénatomos alkilcsoportot jelent,
- azzal a megkötéssel, hogy amikor A egyenesláncú ke-  
vésszé-  
natomos alkilcsoport,  $R^3$  jelentése hidrogén-  
atomtól eltérő,  
vagy gyógyszerileg elfogadható sóik vagy észterek  
előállítására, azzal jellemezve, hogy  
egy (II) általános képletű vegyületet, amelyben  $R^1$  hid-  
rogénatom vagy metilcsoport,  $R^{12}$  hidrogénatom vagy  
hidroxil-védőcsoport, és  $R^{20}$  hidrogénatom vagy karb-  
oxil-védőcsoport, vagy reakcióképes származékát egy  
(III) általános képletű vegyülettel, a képletben  $R^{13}$  hid-  
rogénatom vagy imino-védőcsoport,  $R^{30}$  hidrogén-  
atom, halogénatom, hidroxil-csoport, amely védett is  
lehet, kevés szénatomos alkoxycsoport, kevés szénato-  
mos alkanoil-oxi-csoport, amino- vagy N-(kevésszé-  
natomos)alkil-amino-csoport, kevés szénatomos alkan-  
oil-amino-csoport, aroil-amino-csoport, kevés szénato-  
mos alkil-szulfonil-amino-csoport, szulfamoi-  
l-amino-csoport, amely védett is lehet, cianocsoport, nitro-  
csoport,  $-COOR^4$  általános képletű csoport, amelyben  
 $R^{40}$  hidrogénatom, kevés szénatomos alkilcsoport vagy  
karboxil-védőcsoport, vagy egy  $-CONR^{50}R^{60}$  általános  
képletű csoport, amelyben  $R^{50}$  és  $R^{60}$  azonos vagy  
különböző, és hidrogénatomot, kevés szénatomos alkil-  
csoportot vagy amino- vagy imino-védőcsoportot je-  
lent, vagy  $R^{50}$  és  $R^{60}$  a közbezárt nitrogénatommal  
heterogén csoportot, így aziridinil-, azetidínil-, pi-  
roldinil- vagy piperidinilcsoportot, piperazinilcsoportot,  
amely lehet védett is, 4-(kevésszé-  
natomos)alkil-piperazinil- vagy morfolinilcsoportot ké-  
pezhet, A egyenes vagy elágazó szénláncú kevés szénatomos al-  
kilcsoport,  $X^1 -NR^{70}R^{80}$  általános képletű csoport,  
amelyben  $R^{70}$  és  $R^{80}$  azonos vagy különböző, és hid-  
rogénatomot, kevés szénatomos alkilcsoportot vagy  
amino- vagy imino-védőcsoportot jelent, vagy  
 $-N^+R^9R^{10}R^{11}$  általános képletű csoport, amelyben  $R^9$ ,  
 $R^{10}$  és  $R^{11}$  azonos vagy különböző, és kevés szénato-  
mos alkilcsoportot jelent, azzal a megkötéssel, hogy  
amikor A egyenesláncú kevés szénatomos alkilcso-  
port,  $R^{30}$  jelentése hidrogénatomtól eltérő, reagálta-  
tunk, így (IV) általános képletű vegyületet kapunk,  
amelyben  $R^1$ ,  $R^{12}$ ,  $R^{13}$ ,  $R^{20}$ ,  $R^{30}$ , A és  $X^1$  jelentése a  
fenti, és szükséges esetben a (IV) általános képletű  
vegyületről a védőcsoportokat eltávolítjuk.
15. Antibakteriális szer, amely az (I) általános ké-  
pletű vegyület, a képletben  
 $R^1$  hidrogénatom vagy metilcsoport;
- $R^2$  hidrogénatom vagy negatív töltés;  
 $R^3$  hidrogénatom, halogénatom, hidroxilcsoport, kevés  
szénatomos alkoxycsoport, kevés szénatomos alka-  
noil-oxi-csoport, aminocsoport, N-(kevésszé-  
natomos)alkil-amino-csoport, N,N-di(kevésszé-  
natomos)alkil-amino-csoport, kevés szénatomos alka-  
noil-amino-csoport, aroil-amino-csoport, kevés  
szénatomos alkil-szulfonil-amino-csoport, szulfa-  
moi-  
l-amino-csoport, cianocsoport, nitrocsop-  
ort,  $-COOR^4$  általános képletű csoport, amelyben  
 $R^4$  hidrogénatom vagy kevés szénatomos alkil-  
csoport, vagy  
 $-CONR^{50}R^{60}$  általános képletű csoport, amelyben  
 $R^{50}$  és  $R^{60}$  azonos vagy különböző, és hidrogén-  
atom vagy kevés szénatomos alkilcsoport, vagy  
 $R^5$  és  $R^6$  a közbezárt nitrogénatommal együtt  
heterogén csoportot, így aziridinil-, azetidín-  
il-, piroldinil-, piperidinil-, piperazinil-, 4-(ke-  
vésszé-  
natomos)alkil-piperazinil- vagy morfoli-  
nilcsoportot képez;
- A egyenes vagy elágazó szénláncú kevés szénatomos  
alkilcsoport;
- X  $-NR^7R^8$  általános képletű csoport, amelyben  
 $R^7$  és  $R^8$  azonos vagy különböző, és hidrogénato-  
mot vagy kevés szénatomos alkilcsoportot jelent,  
vagy  
 $-N^+R^9R^{10}R^{11}$  általános képletű csoport, amelyben  
 $R^9$ ,  $R^{10}$ ,  $R^{11}$  azonos vagy különböző, és kevés  
szénatomos alkilcsoportot jelent,
- azzal a megkötéssel, hogy amikor A egyenesláncú ke-  
vésszé-  
natomos alkilcsoport,  $R^3$  jelentése hidrogén-  
atomtól eltérő,  
vagy gyógyszerileg elfogadható sói vagy észterei ha-  
tásos mennyiségét és gyógyszerileg elfogadható hor-  
dozó- vagy hígítóanyagot tartalmaz.
16. A 15. igénypont szerinti antibakteriális szer,  
amely pseudomonasok ellen hatásos.
17. A 15. igénypont szerinti antibakteriális szer,  
amely meticillinre rezisztens *Staphylococcus aureus*  
fajokkal szemben hatásos.
18. A 15. igénypont szerinti antibakteriális szer,  
amely a 11. igénypont szerinti vegyület antibakteriáli-  
san hatásos mennyiségét tartalmazza.
19. Eljárás baktériumfertőzések által okozott beteg-  
ségek kezelésére, azzal jellemezve, hogy az ilyen ke-  
zelést igénylő egyének az (I) általános képletű vegyü-  
let, a képletben  
 $R^1$  hidrogénatom vagy metilcsoport;  
 $R^2$  hidrogénatom vagy negatív töltés;  
 $R^3$  hidrogénatom, halogénatom, hidroxilcsoport, kevés  
szénatomos alkoxycsoport, kevés szénatomos alka-  
noil-oxi-csoport, aminocsoport, N-(kevésszé-  
natomos)alkil-amino-csoport, N,N-di(kevésszé-  
natomos)alkil-amino-csoport, kevés szénatomos alka-  
noil-amino-csoport, aroil-amino-csoport, kevés  
szénatomos alkil-szulfonil-amino-csoport, szulfa-  
moi-  
l-amino-csoport, cianocsoport, nitrocsop-  
ort,  $-COOR^4$  általános képletű csoport, amelyben  
 $R^4$  hidrogénatom vagy kevés szénatomos alkilcso-  
port, vagy

- CONR<sup>5</sup>R<sup>6</sup> általános képletű csoport, amelyben R<sup>5</sup> és R<sup>6</sup> azonos vagy különböző, és hidrogénatom vagy kevés szénatomos alkilcsoport, vagy R<sup>5</sup> és R<sup>6</sup> a közbezárt nitrogénatommal együtt heterogűrűs csoportot, így aziridinil-, azetidínil-, pirrolidinil-, piperidinil-, piperazinil-, 4-(keves szénatomos)alkilpiperazinil- vagy morfolinilcsoportot képez.
- A egyenes vagy elágazó szénláncú kevés szénatomos alkilénecsoport;
- X —NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup> általános képletű csoport, amelyben R<sup>7</sup> és R<sup>8</sup> azonos vagy különböző, és hidrogénatomot vagy kevés szénatomos alkilcsoportot jelent, vagy —N<sup>+</sup>R<sup>9</sup>R<sup>10</sup>R<sup>11</sup> általános képletű csoport, amelyben R<sup>9</sup>, R<sup>10</sup>, R<sup>11</sup> azonos vagy különböző, és kevés szénatomos alkilcsoportot jelent,
- 5 azzal a megkötéssel, hogy amikor A egyenesláncú kevés szénatomos alkilénecsoport, R<sup>3</sup> jelentése hidrogénatomtól eltérő, vagy gyógyászati lag elfogadható sói vagy észterei antibakteriálisan hatásos mennyiségét beadjuk.
20. A 19. igénypont szerinti eljárás, *azzal jellemezve*, hogy a vegyületet pseudomonasok ellen használjuk.
21. A 19. igénypont szerinti eljárás, *azzal jellemezve*, hogy a vegyületet meticillinre rezisztens *Staphylococcus aureus* fajok ellen használjuk.
22. A 19. igénypont szerinti eljárás, *azzal jellemezve*, hogy az ilyen kezelést igénylő egyénnek a 11. igénypont szerinti vegyület antibakteriálisan hatásos mennyiségét beadjuk.
- 10
- 15

